

(19) 日本特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表2007-504227

(P2007-504227A)

(43) 公表日 平成19年3月1日 (2007.3.1)

(5) Int. Cl.		F I		テーマコード (参考)
AO1N	47/06 (2006.01)	AO1N	47/06	4C083
AO1P	17/00 (2006.01)	AO1P	17/00	4D075
C09D	5/14 (2006.01)	C09D	5/14	4H011
C09D	201/00 (2006.01)	C09D	201/00	4I038
C09D	7/12 (2006.01)	C09D	7/12	
		特許請求 未請求 予備特許請求 未請求 (全 28 頁) 最終頁に続く		
(21) 出願番号	特願2006-525350 (P2006-525350)	(71) 出願人	50604939	
(22) 出願日	平成18年8月18日 (2006.8.18)		ボセイドン オーシャン サイエンス	
(65) 特許文書出日	平成18年4月12日 (2006.4.12)		アメリカ合衆国 ニューヨーク州 101	
(68) 国際出願番号	PCT/US2004/026900		68、ニューヨーク、スイート 2805	
(67) 国際公開番号	W02005/025313		、イースト42番ストリート 122	
(67) 国際公開日	平成17年3月24日 (2005.3.24)	(74) 代理人	100096024	
(31) 優先権主張番号	60/500,392		弁理士 植原 三枝子	
(32) 優先日	平成15年9月5日 (2003.9.5)	(72) 発明者	マティアス、ジョナサン、アール、	
(33) 優先権主張国	米国 (US)		アメリカ合衆国 ニューヨーク州 114	
			23、ホーリス、205ストリート 89	
			-26	
		Fターム (参考)	4C083 AC331 AB531 CC02 CC20 CC31	
			EE12	
			4D075 CA45 DC38 EB35	
				最終頁に続く

(54) [発明の名称] 害虫忌避剤としてのメントールプロピレングリコールカーボネートおよびその類似物

(57) 【要約】

【課題】

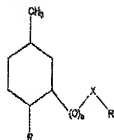
【解決手段】

メントールプロピレングリコールカーボネート、その類似体およびそのような化合物を含む組成物は、昆虫忌避剤として有用である。

【特許請求の範囲】

【請求項1】

ある部位から昆虫を忌避する方法であって、前記部位に昆虫忌避量の次式化合物：



19

式中Rは直鎖もしくは分岐鎖の、置換もしくは非置換低級アルキルラジカル、または直鎖もしくは分岐鎖の、置換もしくは非置換低級アルケニルラジカルを表し、Xはカルボニル結合基(—C(=O)—)または原子価結合を表し、

nは0または1であり、かつ

R'は、nが1の時は、置換もしくは非置換ヒドロキシアルキルオキシおよび置換もしくは非置換ヒドロキシアルキルからなる群より選択されるラジカルを表し、nが0の時は、R'はアルキルアミルラジカルを表す、前記化合物の塗布を含むことを特徴とする前記方法。

【請求項2】

式Iの化合物は、さらに適切な担体を含む組成物の形で塗布され、前記化合物の量が、前記組成物の総重量を基にして、約1重量%～約80重量%であることを特徴とする請求項1に記載の方法。

20

【請求項3】

前記化合物の量は、前記組成物総重量を基にして、約1重量%～約30重量%であることを特徴とする請求項2に記載の方法。

【請求項4】

式Iの化合物は、メントールプロピレングリコールカーボネートおよびイソブテロールプロピレングリコールカーボネートからなる群より選択され、前記化合物が鏡像異性に純粋な形またはラセミ体であることを特徴とする請求項1に記載の方法。

30

【請求項5】

式Iの化合物は、ラセメントールプロピレングリコールカーボネートであることを特徴とする請求項1に記載の方法。

【請求項6】

式Iの化合物は、イソブテロールプロピレングリコールカーボネートであることを特徴とする請求項1に記載の方法。

【請求項7】

前記部位は、少なくとも1匹の生きている動物の外皮であることを特徴とする請求項1に記載の方法。

【請求項8】

前記少なくとも1匹の生きている動物は、ヒトを含むことを特徴とする請求項7に記載の方法。

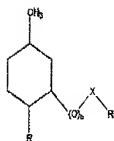
40

【請求項9】

前記少なくとも1匹の生きている動物は、家畜を含むことを特徴とする請求項7に記載の方法。

【請求項10】

次式化合物：



10

式中Rは直鎖もしくは分岐鎖の、置換もしくは非置換低級アルキルラジカル、または直鎖もしくは分岐鎖の、置換もしくは非置換低級アルケニルラジカルを表し、Xはカルボニル結合基(—C(=O)—)または原子価結合を表し、

nは0または1であり、かつ

R' は、nが1の時は、置換もしくは非置換ヒドロキシアルキルオキシおよび置換もしくは非置換ヒドロキシアルキルからなる群より選択されるラジカルを表し、nが0の時は、R' はアルキルアミンラジカルを表す、前記化合物、および

持続放出性担体

を含むことを特徴とする昆虫忌避剤組成物。

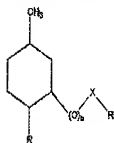
【請求項12】

20

前記担体は、ハロイサイトクレールを含むマイクロチューブルの形をしていることを特徴とする請求項11に記載の組成物。

【請求項13】

化粧品またはパーソナルケア組成物であって、香水、コロソ、消臭剤、制汗剤、スキンケアリム、石鹸、シャンプー、ヘアコンディショナー、ヘアリンス、バスオイル、タルク、日焼け止め、サンスクリーンの群から選択され、前記組成物は次式の化合物：



30

式中Rは直鎖もしくは分岐鎖の、置換もしくは非置換低級アルキルラジカル、または直鎖もしくは分岐鎖の、置換もしくは非置換低級アルケニルラジカルを表し、Xはカルボニル結合基(—C(=O)—)または原子価結合を表し、

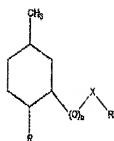
nは0または1であり、かつ

R' は、nが1の時は、置換もしくは非置換ヒドロキシアルキルオキシおよび置換もしくは非置換ヒドロキシアルキルからなる群より選択されるラジカルを表し、nが0の時、R' はアルキルアミンラジカルを表す、前記化合物を含むことを特徴とする前記組成物。

40

【請求項14】

家庭用洗剤組成物であって、クリーナー、洗剤、柔軟剤、芳香剤の群から選択され、前記組成物は次式の化合物：



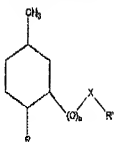
式中Rは直鎖もしくは分岐鎖の、置換もしくは非置換低級アルキルラジカル、または直鎖もしくは分岐鎖の、置換もしくは非置換低級アルケニルラジカルを表し、Xはカルボニル結合基(—C(=O)—)または原子価結合を表し、

nは0または1であり、かつ

R'は、nが1の時は、置換もしくは非置換ヒドロキシアルキルオキシおよび置換もしくは非置換ヒドロキシアルキルからなる群より選択されるラジカルを表し、nが0の時は、R'はアルキルアミラジカルを表す、前記化合物を含むことを特徴とする前記組成物。

【請求項15】

布帛状の製品であって、前記製品は次式の化合物：



式中Rは直鎖もしくは分岐鎖の、置換もしくは非置換型低級アルキルラジカル、または直鎖もしくは分岐鎖の、置換もしくは非置換型低級アルケニルラジカルを表し、Xはカルボニル結合基(—C(=O)—)または原子価結合を表し、

nは0または1であり、かつ

R'は、nが1の時は、置換もしくは非置換ヒドロキシアルキルオキシおよび置換もしくは非置換ヒドロキシアルキルからなる群より選択されるラジカルを表し、nが0の時は、R'はアルキルアミラジカルを表す、前記化合物を組み入れることを特徴とする前記製品。

【請求項16】

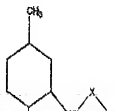
前記布帛は、不織布、織物またはニット布帛であることを特徴とする請求項15に記載の製品。

【請求項17】

前記布帛が蚊帳であることを特徴とする請求項15に記載の製品。

【請求項18】

布帛に昆虫忌避剤を付与方法であって、前記方法は、次式化合物：



鎖もしくは分岐鎖の、置換もしくは非置換型低級アルケニルラジカルを表し、Xはカルボニル結合基 ($-C(=O)-$) または原子価結合を表し、

nは0または1であり、かつ

R' は、nが1の時は、置換もしくは非置換ヒドロキシアルキルオキシおよび置換もしくは非置換ヒドロキシアルキルからなる群より選択されるラジカルを表し、nが0の時は、R' はアルキルアミラジカルを表す、前記化合物を前記布帛に組み入れることを含むことを特徴とする前記方法。

【請求項19】

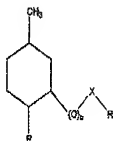
前記化合物は、噴霧、含浸、およびバッチディングによって前記布帛内に組み入れられることを特徴とする請求項18に記載の方法。

10

【請求項20】

コーティング組成物であって、

次式の化合物：



20

式中Rは直鎖もしくは分岐鎖の、置換もしくは非置換型低級アルキルラジカル、または直鎖もしくは分岐鎖の、置換もしくは非置換型低級アルケニルラジカルを表し、Xはカルボニル結合基 ($-C(=O)-$) または原子価結合を表し、

nは0または1であり、かつ

R' は、nが1の時は、置換もしくは非置換ヒドロキシアルキルオキシおよび置換もしくは非置換ヒドロキシアルキルからなる群より選択されるラジカルを表し、nが0の時は、R' はアルキルアミラジカルを表す、前記化合物、および

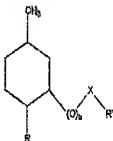
合成ポリマー塗膜形成剤

を含むことを特徴とする前記組成物。

30

【請求項21】

害虫の繁殖から無生物表面を保護するための方法であって、前記方法は次式の化合物：



40

式中Rは直鎖もしくは分岐鎖の、置換もしくは非置換型低級アルキルラジカル、または直鎖もしくは分岐鎖の、置換もしくは非置換型低級アルケニルラジカルを表し、Xはカルボニル結合基 ($-C(=O)-$) または原子価結合を表し、

nは0または1であり、かつ

【請求項 2 2】

前記コーティング組成物は、刷毛塗り、噴霧またはディッピングによって表面に塗布されることを特徴とする請求項 1 8 に記載の前記方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

関連出願の相互参照

本出願は、2003年9月5日提出の、米国仮出願第60/500,392号の便益を主張する。

【0002】

本発明は、メントールプロピレングリコールカーボネートおよびその類似物の昆虫忌避作用に関する。

【背景技術】

【0003】

メントールは、ペパーミントオイルおよびその他ミントオイルから得ることができる天然物である。メントールおよび(-)-イソプレゲール、N-エチル-p-メタン-3-カルボキシアミドおよびp-メタン-3,8-ジオールのようなその各種類似物は、清涼剤として商品に使用されている。これらの化合物は、様々な製品、例えば化粧品、香水、パーソナルケア製品、口腔衛生製品、菓子、タバコ、咳止めドロップ、鼻吸入剤等に清涼感を付与する。Pelzer 他への米国特許第5,703,123号も参照。

【0004】

メントールは、局所痺み止め剤として、および軽い局所麻酔薬および消毒剤のような獣医薬にも、さらには体内の駆風薬および胃鎮静薬としても用いられている。Ivy 他への米国特許第5,124,320号も参照。

【0005】

メントールおよびその各種類似物は、汚れ止め活性を持つことも見出されている。公開国際特許出願第PCT/01/40929号参照。

【0006】

メントールは、日本国特許出願第4305505Aでは、複数ある殺ダニ剤の成分の1つとして、そして日本国特許出願第55104202A号にはゴキブリ忌避剤の必須成分として開示されている。

【0007】

メントールの特定の類似物および誘導体もまた、蚊、マダニ類および小型のダニ類のような有害な昆虫に対する効果的な忌避剤として開示されている。このようなものとしては、Akiyama 他への米国特許第5,959,161号に記載されているp-メタン-3,8-ジオール、Watkins 他への米国特許第6,451,884号に記載されているピロリドン-5-カルボン酸のメチルエステルが挙げられる。

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

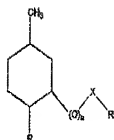
【0008】

少なくとも1つには、活性剤として合成化学物質を含有するタイプの製品に関連する、健康リスクの可能性への一般の関心が高まるのが動機となって、昆虫忌避剤として、またその他の応用で使用する、天然の化学物質の有効性の研究が行われてきた。その結果として、天然化合物に基づく、安全かつ有効な昆虫忌避剤の開発に向かって努力が続けられている。

【課題を解決するための手段】

【0009】

は、有る場所に、昆虫忌避量の次式化合物を塗布することを含む：
(化式：I)



10

式中のRは直鎖もしくは枝分かれ鎖の、置換もしくは非置換低級アルキルラジカル、または直鎖もしくは分岐鎖の、置換もしくは非置換低級アルケニルラジカルを表し、Xはカルボニル連結基(—C(=O)—)または原子価結合を表し、

nは0または1であり、かつ

R' は、nが1の時は、置換もしくは非置換ヒドロキシアルキルオキシおよび置換もしくは非置換ヒドロキシアルキルからなる群より選択されるラジカルを表し、nが0の時は、R' はアルキルアミンラジカルを表す。

【発明の効果】

【0011】

20

この方法は、動物、例えばヒトおよび家畜、植物、植物の一部、種子からの、および同様に無生物からの害虫の忌避に有効である。

【0012】

本発明の別の態様によれば、上記式Iの化合物および持続放出性担体を含む昆虫忌避剤成分が提供される。

【0013】

本明細書に記載の化合物は、化粧品成分またはパーソナルケア組成物としても、さらには家庭用洗浄組成物としても使用でき、このような組成物に昆虫忌避活性を付与できる。

【0014】

本発明はまた、上記式Iの化合物を組み入れた布帛を含む製品、例えば蚊帳、を具現化する。

【0015】

本発明はさらに、上記式Iの化合物を含む、例えば建築および工業向けコーティング塗布のためのコーティング組成物、ならびにこのような組成物を用いて、害虫が構造表面につくのを防ぐ方法を提供する。

【0016】

以下の詳細な説明に見られるように、上記の式Iの化合物は、広範囲の害虫に対する忌避剤として利用できる。

【0017】

公開国際出願第PCT/IN02/00228号には、メントールプロピレングリコールカーボネート 40 およびメントールエチレングリコールカーボネートは、抗掻痒剤中の任意成分として使用されるための「清涼感を伴う保湿剤」の成分として開示されている。しかしながら、知る限りにおいて、本明細書に、本発明の実施に有用であるとして記載されている化合物は、昆虫忌避活性を有するものとして今までに開示または示唆されたことはない。

【図面の簡単な説明】

【0018】

ビレングリコールカーボネートの忌避効果を示す棒グラフである。

【図3】メントールプロビレングリコールカーボネートをDEET、またはシトロネラと組合せた場合に、メントールプロビレングリコールカーボネート単独、上記DEET、およびシトロネラ単独に比べて、較が刺すことに対し優れた忌避効果を示すことを表している棒グラフである。相乗忌避効果は、メントールプロビレングリコールカーボネートとDEETの組合せで得られた。

【発明を実施するための最良の形態】

【0019】

本発明の実施に用いる化合物は、特に Symrise & Co KG および Takasago International US A. を含む販売会社から入手できる。メントールカーボネート誘導体は、望まれる場合には、容易に入手できる出発原料から、Pelzer 他への米国特許第5,703,123号および Mold 他への米国特許第3,419,543号に記載の様式で調製できる。

【0020】

上記の式Iに包含される化合物を参照して、次の定義が適用される：

【0021】

用語「アルキル」は、炭素原子数1~12の、直鎖または分岐鎖の非置換型脂肪族炭化水素基を表す。同様に、用語「アルキル」は、「ヒドロキシアルキルオキシ」、「ヒドロキシアルキル」、「アルキルアミン」等のように、組合せた形で置換基を指名する場合は、1~12個の炭素原子を持つ直鎖または分岐鎖の脂肪族炭化水素基を表す。「低級アルキル」という表現は、炭素原子数1~6の非置換型、直鎖または分岐鎖のアルキル基を表す。

【0022】

用語「置換アルキル」とは、例えば、1~25個の置換基、最も好ましくは1~4個の置換基で置換されたアルキル基を表す。置換基としては、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロ、シクロアルコキシ、オキソ、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールおよび置換アリールが挙げられるが、それらに限定されるものではない。上記のアルキル置換基の中で、特に好ましいものはヒドロキシ置換基である。

【0023】

用語「低級アルケニル」は、炭素原子数1~6の直鎖または分岐鎖の非置換型不飽和炭化水素基を表す。低級アルケニル基の例としては、エテニル、プロベニル、ブテニル、ペンテニル等が挙げられる。

【0024】

用語「置換アルケニル」は、例えば1~12個の置換基、最も好ましくは1~4個の置換基で置換されたアルケニル基を表す。置換基は、アルキル基に関する上記置換基に同じである。

【0025】

用語「アリール」は、フェニル、ナフチル、ビフェニル、インデニル、フルオレニル等のような、環部分に6~15個の炭素原子を有する単環または多環式の芳香族炭化水素基を表し、それぞれは置換できる。

【0026】

用語「置換アリール」は、例えば1~7個の、置換アルキルおよびアルケニル基に関連して先に記した置換基など、好ましくは1~4個の置換基で置換された上記アリール基を表す。

【0027】

用語「ハロゲン」は、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を表す。

【0028】

本明細書では、1つの部分を2個以上の置換基と置換された形で記載する場合、それは複数の置換基のそれぞれが、上記置換基の中から独立に選ばれたことを意味する。

【0030】

本発明の実施での使用に好適な化合物としては：メタノールプロピレングリコールカーボネート、イソブテロールプロピレングリコールカーボネート、メンチル-9-ヒドロキシノニルカーボネート、メントキシプロパン-1,2-ジオール、およびN-エチル-p-メタン-3-カルボキシアミドが上げられる。

【0031】

本明細書に記載のメントールプロピレングリコールカーボネートおよび類似体は、病気媒介体として直接的に、あるいは穀物、食品または織物を破壊するものとして間接的にヒトに危害を及ぼす広範囲の害虫の効果的な忌避剤であることが示されている。以下例示するように、蚊やイエバエの様な飛行虫、アリのような節足虫、シロアリのような穿孔虫に、顕著な忌避作用が得られている。今日までに実施された試験からは、上記の式Iの化合物は、以下の昆虫に対しても忌避剤として有効であろうことが示唆されている：アブラムシ、甲虫、ハチ、穿孔虫、バグ、カスピド (caspids)、毛虫、ゴキブリ、ノミ、ノミハムシ、ミバエ、バッタ、コノハムシ、ハモグリムシ、コナカイガラムシ、モグリバエ、ダニ、ガ、カイガラムシ、クモ、ナメクジ、マダニ、アザミウマ、カリバチ、ゾウムシ、コナジラミ、スズメバチ。本明細書に記載の化合物が忌避剤として使用できる昆虫種の具体的例としては、次のものが挙げられる：

アブラムシ：

Acyrtosiphon pisum (エンドウヒゲナガアブラムシ)、*Aphis fabae*、マメアブラムシ、*Aphis glycines*、ダイズアブラムシ、*Aphis gossypii*、メロンアブラムシ、*Aphis middletonii*、エリゲロンルーツ (*erigeron root*) アブラムシ、*Aphis nerii*、オレアンダー (*oleander*) アブラムシ、*Aphis spiraeola*、シモツケアブラムシ、*Aulacorthum circumflexum*、クレッセントマークドリリー (*crescentmarked lily*) アブラムシ、*Bemisia tabaci*、スイートポテトコナジラミ、*Brachycolus heraclei*、セロリアブラムシ、*Brevicoryne brassicae*、キャベツアブラムシ、*Cavariella aegopdii*、アブラムシの一種、*Gerataphis orchidearum*、サギソウアブラムシ、*Dysaphis apifolia*、ラストイーバンデッド (*rusty-banded*) アブラムシ、*Hyperomyza lactucae*、アブラムシの一種、*Lipaphis erysimi*、カブアブラムシ、*Macrosiphum euphorbiae*、馬鈴薯アブラムシ、*Macrosiphum luteum*、ランアブラムシ、*Melanaphis sacchari*、サトウキビアブラムシ、*Myzus ornatus*、オーネイト (*ornate*) アブラムシ、*Myzus persicae*、モモアカアブラムシ、*Neomyzus circumflexus*、クレッセントマークドリリー (*crescentmarked lily*) アブラムシ、*Neotoxoptera formosana*、クマネギアブラムシ、*Patchiella reaumuri*、クロイモアブラムシ、*Pentalonia nigronervosa*、バナナアブラムシ、*Rhopalosiphum maidis*、トウモロコシの葉アブラムシ、*Rhopalosiphum nymphaeae*、スイレンアブラムシ、*Rhopalosiphum rufiabdominalis*、ライスルーツ (*rice root*) アブラムシ、*Toxoptera aurantii*、ブラックシトラス (*black citrus*) アブラムシ、*Toxoptera citricida*、ブラウンシトラス (*brown citrus*) アブラムシ、*Vesiculaphis caricis*、アブラムシの一種。

アリ：

Anoplolepis longipes、アシナガアリ、*Pheidole megacephala*、ツヤオオズアリ、*Formica* spp.、フィールド (*field*) アリ、*Lasius* spp.、コーンフィールド (*Cornfield*) アリ、*amponotus* spp.、オオアリ科、*Pogonomyrmex* spp.、クロナガアリ、*Tetramorium caespitum*、ペーブメント (*pavement*) アリ、*Monomorium pharaonis*、ファラオ (*pharaoh*) アリ、*Solenopsis molesta*、シーフ (*thief*) アリ、*Linepithema humile*、アルゼンチンアリ、*Solenopsis* spp.、ヒアリ、*Tapinoma melanocephalum* (アワテコヌカアリ)、ゴースト (*Ghost*) アリ、*Crematogaster* spp.、シリアダアリ科、*paratrechina longicornis*、クレイジー (*crazy*) アリ、*Anoplolepis gracilipes*、アシナギアリ。

ーズビートル (Fuller rose beetle)、*Attagenus Mezatoma*、ヒメカツオブシムシ、*Carpophilus hemipterus*、コメノケシキスイ、*Carpophilus humeralis*、イエローショルダー
 ドサウーリングビートル (yellowshouldered souring beetle)、*Chaetocnema confinis*、
 サツマイモノミハムシ、*Coleoptera*、甲虫の一種、*Cosmopolites sordidus*、バナナル
 トポーラ (banana root borer)、*Cryptorhynchus mangiferae*、マンゴゾウムシ、*Cylas*
formicarius elegantulus、サツマイモゾウムシ、*Elytroteinus subtruncatus*、フィジー
 ジンジャーゾウムシ、*Epitrix hirtipennis*、タバコノミハムシ、*Euscepus postfasciatus*、
 西インド諸島サツマイモゾウムシ、*Hamonia axyridis*、マルチカラードアジアンレ
 ディービートル (Multicolored Asian Lady Beetle)、*Hypothenemus obscurus*、トロピカ
 ルナッツポーラ (tropical nut borer)、*Lasioderma serricorne*、シガレットビートル 10
 (Cigarette beetle)、*Lema trilinea*、スリーラインドポテトビートル (three-lined po
 tato beetle)、*Listroderes difficilis*、ヤサイゾウムシ、*Maruca testulalis*、マネノ
 メイガ、*Orphis anastomosalis*、サツマイモノメイガ、*Orchidophilus aterrimus*、オオ
 ランヒメゾウムシ、*Orchidophilus peregrinator*、ショウランヒメゾウムシ、*Oryzaephilus*
mercator、オオメノコギリヒラタムシ、*Otiorynchus cribricollis*、クリバート (cri
 bate) ゾウムシ、*Popillia japonica*、マメコガネ、*Protaetia fusca*、マンゴフラワー
 ビートル (mango flower beetle)、*Stegobium paniceum*、ドラッグストアビートル (Drugs
 tore beetle)、*Tribolium castaneum*、コクヌストモドキ、*Tribolium confusum*、ヒラタ
 コクヌストモドキ、*Xyleborus affinis*、キクイムシの一種、*Xyleborus crassiusculus*、キ
 クイムシの一種、*Xyleborus fornicatus*、キクイムシの一種、*Xylosandrus compactus*、
 ブラックツウィッグポーラ (black twig borer)、

ハチ：

Apis mellifera、アフリカまたはヨーロッパミツバチ、*Xylocopa* sp.、クマバチ

穿孔虫：

Maruca testulalis、マメノメイガ、*Ostrinia nubilalis*、ヨーロッパアワノメイガ、

バグ：

Antianthe expansa、ナスツノゼミ、*Coptosoma xanthogramma*、ブラックスティンクバグ
 (black stink bug)、*Cyrtopeltis modestus*、トマトバグ、*Draeculacephala minerva*、
 グラスシャープシューター (grass sharpshooter)、*Empoasca stevensi*、ステイブン
 ス (Stevens) ヨコバイ、*Gnorimosphaeroma* sp.、オカダンゴムシ、*Hyalopeplus pelluci*
us (Stevens) トウメイウイングプラントバグ (transparentwinged plant bug)、*Hemiptera*、バ
 グの一種、*Lamenia caliginosa*、フルゴリッドプラントホッパー (flugorid planthopper)
 の一種、*Lepismatidae* spp.、セイヨウシミ、*Leptocoris trivittatus*、イースタンボッ
 クスバグ (Eastern Box bug)、*Leucopepla albofasciata*、ノミハムシの一種、*Melorme*
nis basalis、西インド諸島ハゴロモ、*Nabis capsiformis*、パールダムセルバグ (pale d
 amsel bug)、*Nezara viridula*、ミナミアオカメムシ、*Nysius nemorivagus*、ナガカメム
 シの一種、*Nysius nigricutellatus*、ナガカメムシの一種、*Plautia stali*、チャバネア
 オカメムシ、*Pycnoderes quadrimaculatus*、ビーンカスピド (bean caspid)、*Siphanta*
acuta、トービードバグ (torpedo bug)、*Spanagoricus albofasciatus*、ホワイマーク
 ド (Whitenarked) ノミハムシ、*Spissistilus festinus*、スリーコーナーダルファルフ
 アホッパー (threecornered alfalfa hopper)、*Tarophagus colocasiae*、タロデルファシ
 ド (taro delphacid)、*Vanduzeeia segmentata*、バンジー (Van Duzee) ツノゼミ、

カスピド：

Pycnoderes quadrimaculatus、マメカスピド、

ケムシ：

Achaea lanata、クロトン (croton) ケムシ、*Acrolepis assectella*、リーク (leek) ガ

oderus amplicollis, ガルフ ワ이어ワーム (Gulf wireworm), Cryptoblabes gnidiella, クリスマスベリーウェブワーム (Christmas berry webworm), Cryptophlebia illepidia, コアシードワーム (koa seedworm), Cryptophlebia onbrodelia, ライチフルーツ (litchi fruit) ガ, Dephnia nerii, オレアンダーホークモス (oleander hawk moth), Delia platura, タネバエ, Empoasca solana, サザンガーデンヨコバイ (southern garden), Hedylecta blackburni, ココナツツハマキムシ, Helicoverpa zea, オオタバコガ, Helicoverpa undalis, 輸入キャベツウェブワーム, Keiferia lycopersicella, トマトギョウ虫, Lampides boeticus, マメチョウ (bean butterfly), Othreis fullonia, パシフィックフルーツピアシング (Pacific fruit-piercing) ガ, Pelopidas thrax, バナナスキッパー (banana skipper), Penicillaria jocosatrix, マンゴシュートキャタピラ (mango shoot caterpillar), Peridroma saucia, 斑入り (variegated) ヨトウムシ, Phthorimaea operculella, 馬鈴薯チューバーワーム (tuberworm), Pieris rapae, 輸入キャベツワーム, Plutella xylostella, ダイヤモンドバックモス (diamondback moth), Spodoptera exempta, ナットグラスアミーワーム (nutgrass armyworm), Spodoptera exigua, ビートアミーワーム (beet armyworm), Spoladea recurvalis, ハワイビートウェブワーム, Strymon echion, 大型ランタナバタフライ (larger lantana butterfly), Trichoplusia ni, キャベツシャクトリムシ, Vanessa cardui, ペインティッドレディバタフライ (painted lady butterfly),

ゴキブリ:

Blaberus craniifur, デスヘッド (death's-head) ゴキブリ, Blaberus discoidalis, デスコイド (discoid) ゴキブリ, Blatta orientalis, オリエンタルゴキブリ, Byrsotria fumigata, キューバモグラゴキブリ, Diploptera punctata, ビートルローチ (beetle roach), Eublaberus posticus, ホラアナゴキブリ, Gromphadorhina portentosa, ヒッシング (hissing) ゴキブリ, Leucophaea maderae, マデイラ (Madeira) ゴキブリ, Periplaneta americana, 一般的なアメリカのゴキブリ, Periplaneta brunnea, チャパネゴキブリ, Periplaneta fluglinosa, ガスケーチャパネゴキブリ, Schultesia lampyridiformis, ファイヤーフライローチ (firefly roach), Supella longipalpa, チャオビゴキブリ,

ノミ:

Ctenocephalides felis (Bouche), ネコノミ, Siphonaptera, ノミの一種

30

ノミハムシ:

Leucopocilia albofasciata, ノミハムシの一種, Spanagoniscus albofasciatus, ホワイトマークド (whitemarked) ノミハムシ,

ハエ:

Asilidae sp. ムシヒキアブ, Bactrocera cucurbitae, ウリミバエ, Geratopogonidae sp. (ヌカカ科), Chironomidae sp. (ユスリカ科), Condoderus amplicollis, ガルフワイアーワーム (Gulf wireworm), Contarinia maculipennis, ブロッサムミッジ (blossom midge), Culicidae sp (カ科), Dasineura mangiferae, マンゴブロッサムミッジ (mango blossom midge), Delia echinata, カーネーションチップマゴット (carnation tip maggot), Delia platura, シードコーン (seedcorn) マゴット, Eumerus figuratus (スマキハイジマハナアブ), ジンジャーマゴット, Eurychoromyidae sp. (シマバエ科), ブロードヘッデッド (Broad headed) バエ, Milichidae sp. (コガネバエ科), 小型ハエ, Mydidae sp., ハエ, Musca domestica, イエバエ, Ophiomyia phaseoli, ビーン (bean) バエ, Phoridae sp. (ノミバエ科), Sciaridae sp. (クロバネキノコバエ科), Simuliidae sp (ブユ科), クロバエ, Syrphidae sp (ミギワバエ科), ハナバエ, Tachinidae sp., ヤドリバエ, Tanyderidae sp (ニセヒメガガンボ科), プリミティブクレーン

40

roceria latifrons (マレーシアアミバエ)、ナスミバエ、*Ceratitis capitata*, チチュウカイミバエ、*Drosophilidae* sp., ミバエ、*Tephritidae* sp. (ミバエ科)、ミバエ。

バクダ:

Atractomorpha sinensis, ピンクウイング (pinkwinged) バクダ、*Conocephalus saltator*, ロングホーン (longhorned) バクダ、*Elinae punctifera*, ナロウウイング (narrow winged) キリギリス、

ヨコバイ:

Empoasca solana, サザンガーデン (southern garden) ヨコバイ、*Empoasca stevensi*, スティーブンス (Stevens) ヨコバイ、*Sophonia rufofascia*, ツースポットド (two-spotted) ヨコバイ、

10

ハモグリ:

Acrolepiopsis sapporensis (ネギコガ)、アジアオニオンハモグリ、*Bedellia orchilella*, サツマイモハモグリ、*Liriomyza brassicae*, サーペンチン (serpentine) ハモグリ、*Liriomyza huldobrensis* (アシドロハモグリ)、エンドウハモグリ、*Liriomyza sativae*, ベジタブルハモグリ、*Liriomyza trifolii* (マメモグリバエ)、キクハモグリ、*Pjylloncinistis citrella*, ミカンハモグリ、

コナカイガラムシ:

Antonia graminis, ローデスグラス (Rodesgrass) イガラムシ、*Dysmicoccus brevipes*, パイナップルコナカイガラムシ、*Dysmicoccus neobrevipes*, グレイパイナップルコナカイガラムシ、*Ferrisia virgata*, スジコナカイガラムシ、*Geococcus coffeae*, コーヒールート (coffee root) コナカイガラムシ、*Nipaecoccus nipae*, ココナッツコナカイガラムシ、*Nipaecoccus viridis*, ハイビスカスコナカイガラムシ、*Phenacoccus gossypii*, メキシココナカイガラムシ、*Planococcus citri*, ミカンコナカイガラムシ、*Pseudococcus dendrobiorum*, デンドロビウムコナカイガラムシ、*Pseudococcus jackbeardsleyi*, ジャックビーズリー (Jack Beardsley) コナカイガラムシ、*Pseudococcus longispinus*, ロングテイルド (longtailed) コナカイガラムシ、*Pseudococcus virburni*, オブスキュア (obscure) コナカイガラムシ、

モグリバエ (MINERS):

Metanagromyza splendida, バニバナクキモグリバエ、

ダニ (MITES):

30

Aculops lycopersici, トマトサビダニ、*Brevipalpus obovatus* (チャイロヒメハダニ)、プリベット (privet) ダニ、*Brevipalpus phoenicis*, レッドアンドブラックフラット (red and black flat) ダニ、*Calacarus brionesae*, パパヤリーフエッジローラ (papaya leaf edgeroller)、*Eotetranychus sexmaculatus*, シックススポットティッド (sixspotted) ダニ、*Eriophyes mangiferae*, マンゴバッド (mango bud) ダニ、*Eutetranychus banksi*, テキサスミカンダニ、*Oligonychus mangiferus*, マンゴハダニ、*Panonychus citri*, ミカンアカダニ、*Polyphagotarsonemus latus*, ブロード (broad) ダニ、*Siteroptes framini*, クサダニ、*Steneotarsonemus furcatus*, タロイモホコリダニ、*Steneotarsonemus pallidus*, シクラメンダニ、*Tetranychus cinnabarinus*, カルミン (carmine) ハダニ、*Tetranychus desertorum*, サバクハダニ、*Tetranychus neocalidomus*, ヤサイダニ、*Tetranychus tumidus*, チューミッド (tumid) ハダニ、*Tuckerella ornata*, タッカレルリッド (Tuckerellid) ダニ、*Tuckerella pavoniformis*, タッカレルリッドダニ、*Varronia jacobsoni*, バロア (Varroa) ダニ、

40

ガ:

Actias luna, ヤマユガ、*Anisota* sp., オークワーム (Oakworm) ガ、*Antheraea polyphemus*, ポリフェムス (Polyphemus) ガ、*Automeris io*, アイオー (Io) ガ、*Callosamia* s

ロージング (clothing) ガ、*Trichophaga tapetzella*、カーベットまたはタペストリーガ、
蚊:

Aedes sp. (ヤブカ科)、*Anopheles* sp. (ハマダラカ科)、*Coquillettidia* sp.、*Culex* sp. (アカイエカ科)、*Culiseta* sp. (ハボシカ科)、*Ochlerotatus* sp. (ヤブカ科)、*P. sorophora* sp. (ヤブカ科)、

カイガラムシ:

Abgrallaspis cyanophylli、マルカイガラムシの一種、*Aspidiella hartii*、ターメリックルート (turmeric root) カイガラムシの一種、*Aspidiotus destructor*、ココナツツカイガラムシ、*Aspidiotus nerii*、オレアンダーカイガラムシ、*Asterolecanium pustulans*、オレアンダービット (oleander pit) カイガラムシ、*Ceroplastes rubens*、ルビーロウカイガラムシ、*Chrysomphalus aonidum*、フロリダアカカイガラムシ、*Chrysomphalus dictyospermi*、ディクティオスベルムム (*dictyospermum*) カイガラムシ、*Clavaspis herculeana*、マルカイガラムシの一種、*Coccus hesperidum*、ブラウンソフト (brown soft) カイガラムシ、*Coccus longulus*、ロングブラウン (long brown) カイガラムシ、*Coccus viridis*、ミドリカイガラムシ、*Diaspis boisduvalii*、ボイスデュバル (*Boisduval*) カイガラムシ、*Diaspis bromeliae*、パイナップルカイガラムシ、*Diplaspis diotus claviger*、マルカイガラムシの一種、*Florinia florinae*、アボガドカイガラムシ、*Furcaspis bifornis*、レッドオーキッド (red orchid) カイガラムシ、*Hemiberlesia lataniae*、ラタニア (*latania*) カイガラムシ、*Hemiberlesia rapax*、グリーディ (*Greedy*) カイガラムシ、*H. owardia biclavata*、マイニング (*mining*) カイガラムシ、*Icerya puchasi*、ワタフキカイガラムシ、*Ischnaspis longirostris*、クロイトカイガラムシ、*Kilifia acuminata*、アキユミネイト (*acuminate*) カイガラムシ、*Melanaspis bromeliae*、ブラウンパイナップルカイガラムシ、*Morganella conspicua*、マルカイガラムシの一種、*Parasaissetia nigra*、ニグラ (*nigra*) カイガラムシ、*Parlatoria proteus*、バリエブルチャフ (*variable chaff*) カイガラムシ、*Pinnaspis aspidistrae*、シダカイガラムシ、*Pinnaspis buxi*、ティ (ti) カイガラムシ、*Pinnaspis strachani*、ハイビスカスノウカイガラムシ、*Protopulvinaria mangiferae*、マンゴソフトカイガラムシ、*Pseudaulacaspis cockerelli*、コッカレル (*Cockerell*) カイガラムシ、*Pulvinaria mameae*、大型ワタカイガラムシ、*Pulvinaria psidii*、グリーンシールド (*green shield*) カイガラムシ、*Pulvinaria umbicola*、ワタサツマイモ (*cottony sweetpotato*) カイガラムシ、*Saissetia coffeae*、ハンエンカクカイガラムシ、*Saissetia neglecta*、カリビアンブラックカイガラムシ、*Vinsonia stellifera*、ホシ (*stellate*) カイガラムシ、

クモ:

Araneidae sp. (コガネグモ科)、円網性種、*Atrax* sp. (ウゴグモ科)、ジョウゴグモ、*L. oxosceles* sp. (イトグモ科)、リクルース (*Recluse*) またはバイオリン (*violin*) グモ、*Lycosidae* sp. (コモリグモ科)、ウルフ (*Wolf*) グモ、*Rholicidae* sp. (ユウレイグモ科)、セラー (*Cellar*) グモ、*Salticidae* sp. (ハエトリグモ科)、ハエトリグモ、*Tegeonaria agrestis*、ホーボー (*Hobo*) またはアグレッシブハウス (*Aggressive house*) グモ、

ナメクジ:

Vaginulus plebius、ブラウンナメクジ、*Veronicella leydigii*、ブラックナメクジ
マダニ (TICKS):

Amblyomma americanum、ローンスター (*Lone Star*) マダニ、*Dermacentor variabilis*、アメリカヌマダニ、*Ixodes scapularis*、シカマダニ、*Rhipicephalus sanguineus*、チャイロヌマダニ、

ウマの一種、*Elixothrips brevisetis*、バナナの皮アザミウマ、*Frankliniella occidentalis* (ミカンキイロアザミウマ)、ミカンキイロアザミウマ、*Frankliniella shultzei*、キイロハナアザミウマ、*Haplothrips gowdeyi*、クロハナアザミウマ、*Heliothrips errans*、シンビジウムアザミウマ、*Haliophrips haemorrhoidalis*、オンシツアザミウマ、*Hercinothrips femoralis* (クリバネアザミウマ)、オビオンシツアザミウマ、*Leucothrips pferci*、アザミウマの一種、*Schultzei*、キイロハナアザミウマ、*Sciothrips cardamomi*、カルダモン (*cardamom*) アザミウマ、*Scirtothrips dorsalis*、アザミウマの一種、*Selenothrips rubrocinctus*、アカオビアザミウマ、*Thrips alliorum*、アザミウマの一種、*Thrips hawaiiensis*、ハワイハナアザミウマ、*Thrips nigropilosus*、キクアザミウマ、*Thrips palmi*、メロンアザミウマ、*Thrips tabaci*、タマネギアザミウマ、

10

カリバチ:

Bephratelloides cubensis、アノナシード (*Annona seed*) カリバチ、*Eurytoma orchidea* rum、オーキッドフライ (*orchidfly*)、*Polistes* sp. (アシナガバチ科)、*Asynagabachi*、*Sphecidae* sp. (ジガバチ科)、ジガバチ、

ゾウムシ:

Anthonomus eugenii、ペッパー (pepper) ゾウムシ、*Diaprepes abbreviatus*、ミカンルート (*Citrus root*) ゾウムシ、

コナジラミ:

Aleurocanthus spiniferus、オレンジスパイニ (*orange spiny*) コナジラミ、*Aleurodicus dispersus*、スパイラリング (*spiral*) コナジラミ、*Aleurothrix antidesmae*、コナジラミの一種、*Aleurothrix floccosus*、ウール (*woolly*) コナジラミ、*Aleurotulus anthuricola*、アンスリウム (*anthurium*) コナジラミ、*Bemisia argentifolii*、シルバーリーフ (*silverleaf*) コナジラミ、*Bemisia tabaci*、サツマイモコナジラミ、*Crenider sum. sp.*、コナジラミの一種、*Orchamoplatus mammaeferus*、クロトン (*croton*) コナジラミ、*Paraleyrodes perseae*、ブルメリア (*plumeria*) コナジラミ、*Trialeurodes vaporariorum*、オンシツコナジラミ、

20

スズメバチ:

Vespa vulgaris (キオビクロスズメバチ)、一般的なスズメバチ、*Vespa maculifrons*、イースタンスズメバチ、*Vespa germanica*、ジャーマン (*german*) スズメバチ、*Vespa crabro*、オオスズメバチ。

30

[0032]

発明の方法の実施では、式Iの化合物をそのまま、または適切な担体もしくはほビヒクルと混合して得た組成物の成分として用いることができる。担体またはほビヒクルの性質は、塗布または投与の様式によって変わるだろう。

[0033]

発明の昆虫忌避剤組成物は、組成物の全重量に基づいて、一般的に約1〜約80重量%、有効量の式Iの化合物を含むように調合される。その中に存在する式Iの化合物の量が1重量%未満の組成物は、目的の効果を生まないことが見出されている。組成物は、場合によって、担体またはほビヒクルを構成している1または複数の不活性成分とバランスをとって、約3〜約80重量%のスキンコンディショナを含むことができる。特に満足できる昆虫忌避効果は、上記式の化合物、好ましくはメントールプロピレングリコールカーボネートのラセミ混合物を約1〜約30重量%含んでいる調合物を用いた時に得られている。イソプロピルプロピレングリコールカーボネートも良い結果を生んでいる。これら化合物は、ヒト、家畜、ペット、植物、植物の一部および種子の外皮または皮膚に安全に塗布できる。

40

[0034]

本明細書に記載の化合物が生ずる昆虫忌避効果は、次に開示されるわけではないが、各々

等を含む、家庭用洗浄製品に組み入れてもよく、これら製品は液体または固体いずれの形でもよい。これら製品は、典型的には、上記式Iの化合物または化合物の混合物を、製品の自重に基づいて、約1~80重量%含む。昆虫忌避剤化合物はまた、肥料、マルチ、および鉢植え用調製物と混ぜてもよい。

[0035]

式Iの化合物は、組成物の中で単独の昆虫忌避剤として使用でき、また有用な昆虫忌避剤である他の天然もしくは合成作用物質と組み合わせて用いてもよい。これらのものとしては、N,N-ジエチル-m-トルアミド (DEET) ; N,N-ジエチルベンズアミド ; シトロネラ ; トルーバルサム ; ペルーバルサム ; ユーカリ油 ; ヒューオンバインオイル ; 樟脳 ; サイプレスオイル ; ガルバナム ; ジエチルフクレート ; ジメチルフクレート ; ジブチルフクレート ; 1,2,3a,4,5,5a,6,7,8,9,9a,9b-ドデカヒドロ-3a,6,9a-テトラメチルナフト [2,1-b] フラン ; 4-(トリシクロ [5.2.1.0^{2,4}]) デシリデン-8) ブタナール ; 1-エトキシ-1(2'-フェニルエトキシ)エタン ; アセチルセドレンおよびプロピリデンフタリドが挙げられるが、これらに限定されない。

[0036]

上記組成物に様々な補助成分を加えて、それに所望の性質または特徴を付与し、または特別な形態の塗布または投与を容易することができる。これら補助成分としては、当技術分野で一般的に用いられる、芳香剤、界面活性剤、噴射剤、乳化剤、分散剤、緩衝剤、保存剤、抗菌化剤、希釈剤、溶媒および固定剤を挙げることができるが、これらに限定されるわけではない。

[0037]

微生物の有害活性は、様々な抗菌剤および抗真菌剤、例えばパラベン、クロロブタノール、フェノール、ソルビン酸等を加えることで阻止できる。

[0038]

上記組成物は、塗布または投与の様式に応じて、様々な形に調製できる。従って、組成物は、局所塗布のためのローション、クリーム、軟膏、ゲル剤またはパウダー、あるいは噴霧もしくはエアゾールスプレーとして使用するための溶液または懸濁液の形にできる。

[0039]

本明細書に記載の化合物および組成物は、当技術分野周知のように、持続放出性もしくは制御放出性成分または様々なタイプの担体、例えば有機もしくは無機粒子と一緒に調合することも、あるいは局所使用のためにアルコールまたは水を基本にした調合物に調合してもよい。

[0040]

本発明の実施に用いる組成物は、当技術分野周知の各種の方法によって調製できる。典型的には、そのような組成物は、式Iの化合物を適切な担体物質、および、場合により望まれる1または複数の補助成分となじませ、要望どおりに、得られた混合物を適切な容器またはディスペンサに入れることで調製される。

[0041]

本明細書に記載の化合物および組成物は、動物および植物だけでなく、無生物にも有益に用いられ、所望の昆虫忌避効果を生む。大部分の例では、発明の昆虫忌避組成物は、処理対象となる部位または表面に局所的または外部に塗布され、そして所望の昆虫忌避レベルを維持するために、定期的に繰り返して塗布される。

[0042]

本明細書に記載の化合物は、処理表面から昆虫を忌避させることによって、虫がつくのを防ぐために、構造物用および産業用コーティング製品などの各種コーティング組成物にも有益に用いることができる。このようなコーティング組成物は、1または複数の上記式I

【0043】

ある特定の用途のために実際に選ばれる塗膜形成剤は、保護する物体の材料および構造に応じて変わる。表面に本発明による保護コーティングを施すと、コーティング組成物中に存在する式Iの活性成分が、その昆虫忌避効果を提供し、それによって処理された表面は虫がつくことから保護される。様々な合成ポリマーが、コーティングの塗布に有用な塗膜形成剤であることが知られている。適切なポリマー樹脂の例としては、ポリエステル（例えばアルキド）樹脂、不飽和ポリマー（例えばアクリル）樹脂、ビニルエステル、酢酸ビニルおよび塩化ビニルをベースにした樹脂、ウレタンをベースにした樹脂、エポキシ樹脂ならびにシリコン樹脂、またはその組合せが挙げられる。不飽和ポリエステル樹脂は、不飽和の酸および無水物、飽和酸および無水物（最終樹脂の不飽和度を制御するため）、ならびにポリヒドロキシアルコール、通常はグリコールから作られる。好適な塗膜形成剤成分は、ポリウレタン、エポキシ、アルキドおよびシリコン樹脂である。本発明の実施に適切な市販の塗料用ビヒクルとしては次のものが挙げられる：Benwood Interior Wood Finishing浸透塗料234およびBenwood Interior Wood Finishingポリウレタン塗料228（共にBenjamin Moore Paints）；Vas Sickle Exteriorラテックス塗料（Van Sickle Paints, Lincoln, Nebraska）；Polane G PlusポリウレタンエナメルおよびACRL-PRO 100フラット外装用アクリル塗料（共にPorter Paint, Louisville, Kentucky）；ならびにWearlonノンスティックコーティング（水ベースのシリコン/エポキシコーティング）（Environmental Coatings, LLC）。

【0044】

本発明のコーティング組成物は、1つまたは複数の望ましい特性、例えば色、硬さ、強度、剛性、浸透性、耐水性等を付与するために、上記の式Iの1または複数の化合物および塗膜形成成分を加えた成分を含んでよい。このような特性を付与する具体的な成分または成分の群を選択することは、当業者の能力の範囲内である。

【0045】

虫がつくことから効果的に保護するのに必要な、コーティング組成物中の忌避化合物の割合は、化合物そのもの、塗膜形成剤の化学的性質、ならびに忌避化合物の効力に影響を与える組成物中に存在するその他添加物によって変わる場合がある。一般的には、忌避化合物は、コーティング組成物の重量の約1～約80%含まれ、好適には組成物の重量の約5～約50%含まれる。

【0046】

上記の式Iの化合物は、塗料製造工程の間に塗料調合物に加えても、または使用時に塗料に添加してもよい。式Iの化合物は、塗料ビヒクル内に簡単に混ぜればよい。忌避化合物はまた、ポリマー樹脂に共有結合してもよい。さらには、式Iの化合物は、コーティングマトリックスからの化合物の持続的放出を提供し、それによってコーティングの効果を延長し、昆虫忌避効果を生ずるのに必要な活性化合物の量を減らす徐放性物質と組み合わせることもできる。このような徐放性物質の中に封入することはまた、コーティングの有害な化学環境から活性成分を保護し、活性化合物が分解しやすい場合には、樹脂内に閉じ込められている間にそれらが分解しにくくする。適切な制御放出材料の例としては、リポソーム、ナノカプセル、脂質マイクロチューブル、金属マイクロチューブル、ポリマーおよびハロイサイトマイクロチューブルが挙げられる。

【0047】

コーティング表面の昆虫忌避効果は、上記式Iの化合物を、表面濃度約1～600mg/cm²、より好適には約10～約80mg/cm²、最も好適には約30～約50mg/cm²で使用することによって得られる。蚊の忌避には、約300～約600mg/cm²のオーダーの比較的高い濃度が用いられる。

【0048】

【0049】

本明細書に記載の化合物はまた、布帛基材の中に組み入れて、布帛に昆虫忌避剤を付与することもできる。忌避化合物は、繊維製造工程、例えば乾式紡糸の間に、各種合成繊維と組み合わせることができる。この方法で作られた繊維としては、ポリエステル、ポリアミド（好ましくはナイロン）、アクリルおよびポリオレフィン（好ましくはポリエチレン）繊維が挙げられるが、それらに限定されるわけではない。こうして得た繊維またはフィラメントを撚り糸に紡ぎ、次にこれを織るか、または編んで、最終の昆虫忌避布帛にする。もちろん、織布は、単独のフィラメントからも作ることができる。得られた繊維は、また不織布の製造にも用いることができる。

【0050】

忌避化合物はまた、粒径がマイクロメートルからナノメートルの範囲である微粒子状の担体に結合して、紡いだ繊維のクラディングまたはコアに含めてもよい。特定の担体を適切に選択して、悪条件の熱作用、例えば溶融紡績作業中の熱作用から忌避化合物を守ることができる。この目的に適した粒状担体としては、ポリマーカプセル、ハロイサイトマイクロチューブルおよび金属マイクロチューブルが挙げられるが、それらに限定されるわけではない。ハロイサイトマイクロチューブルのような担体はまた、得られた繊維からの昆虫忌避剤の制御放出を可能にする。遅延放出性の昆虫忌避布帛に関係する米国特許第6,326,015号も参照。

【0051】

または、昆虫忌避剤は、完成した布帛に、例えば噴霧、含浸、パッディング（浸漬タンク 20 と絞りローラを用いた）等により、塗布してもよい。

【0052】

昆虫忌避布帛は、軍隊が使用するバトルドレスユニフォームなど衣類、テント布帛、蚊帳、バンダナ、動物用床材、または木やその他の植物の保護包装材を含む多様な有用物に変えることができるが、それらに限定されるわけではない。昆虫忌避化合物は、布帛が完成品にされた後で、布帛に塗布することもできる。本発明の昆虫忌避剤は、木綿布またはネットにも塗布できる。

【0053】

本明細書に記載の昆虫忌避化合物は、蚊帳に昆虫忌避剤を塗布するのに用いられる。蚊帳を殺虫剤で処理する実際の手順については、www.pathcanada.orgに記載されており、その説明は、参照により本明細書に組み入れられる。

【0054】

シロアリおよびその他の穿孔虫から、木材構造を保護するのに効果的なバリアシートもまた、1または複数の上記式Iの昆虫忌避化合物を含むことができる。このようなバリアシートは、ポリマーフィルムに形成してもよく、それらは使用するポリマーの性質に応じて、通常の成形、注型成形または射出成形法により製造できる。昆虫忌避化合物のポリマーフィルムへの組み込みは、制御放出態様を含む上記の合成ポリマー繊維についての記載と同様にして実施できる。昆虫忌避剤は、適合性ポリマーと忌避剤の物理的な溶融結合混合物を手段としてフィルム基材に塗布することもでき、それは米国特許第6,319,511号に記載されている様式で、間隔のあいたスポットでフィルム基材と結合する。

【0055】

上記のように調製した昆虫忌避剤含有繊維は、米国特許第6,052,943号に記載のような、農業害虫管理用保護バリアを形成するのに用いることができる。

【0056】

以下実施例では、本発明をさらに詳細に記載する。これらの実施例は、例示だけを目的として提供されており、いかなる形でも本発明を制限しようとするものではない。これら案

【実施例1】

【0058】

成虫の蚊 (*Culex quinquefasciatus*) を2フィート×2フィート×2フィートのスクリーンチャンパーの中に、200匹/チャンパーの密度で飼育した。蚊は、幼虫から羽化したのち3~10日齢であり、各試験前に24時間絶食させた。各試験化合物 (Symrise GmbH & Co Kg, Holzminden, Germanyより無償で提供された) を市販のローション基剤 (Cresto Laboratories, Manila, Philippines) に加え、電動ミキサーを用いてローションと良く混合した。得られた調合物をヒトボランティアの肘から指先に塗布した。次に塗布したボランティアの腕を、順番に、肘までチャンパー内に差し入れた。各調合物について、蚊が最初に刺すまでの時間の長さとして保護時間を決定し、蚊が刺した時点で試験を終了した。表Iのデータは、試験した化合物の、この方法で決定した保護時間を示している。

【0059】

【表1】

表1

化合物名	保護時間 (分) *
1-5-メチル-2-イソプロピルシクロヘキサノール (1-メントール)	30±9
5-メチル-2-(1-メチルエチニル) シクロヘキサノール ((-)-イソブレゴール)	56±7
メントキシプロパン-1,2-ジオール	68±17
N-エチル-p-メタン-3-カルボキシアミド	92±31
メントールプロピレングリコール-カーボネート	68±15
ラセメントールプロピレングリコール-カーボネート	263±17
イソブレゴールプロピレングリコール-カーボネート	152±36
メントール-9-ヒドロキシニル-カーボネート	79±14

*試験群当たり4名のボランティアについての平均値±標準誤差。化合物は、組成物全重量を基に、5重量%の濃度でローション基剤に加えられた。

【0060】

データは、メントールプロピレングリコール-カーボネートが、メントールまたはイソブレゴールに比べ、蚊に刺されることの予防についてほぼ9倍効果的であることを示している。メントールプロピレングリコール-カーボネートの性能は、試験に用いた化粧品処方方に依存して変わるだろう。

【0061】

さらに、実験では、蚊が刺すことに対するラセメントールプロピレングリコール-カーボネートの阻止効果は、用量依存的な様式で生ずることを明らかにした。これらの結果は、図1に示している。

【実施例2】

【0062】

世界中に分布しており、また家庭の害虫として知られていることから、このアリ忌避剤試験にはアカアリ (ファラオ (pharaoh) アリ、*Monomorium pharaonis*) を選択した。

【0063】

アカアリは、食物の香りに引きつけられる。本実験の誘引物質はチョコレートであり、これを試験前の5時間、テーブルの上に置いた。テーブルの周囲の床に放した後2時間以内に、アカアリは床からテーブルの脚を上るルートを確立した。5時間目に、2濃度のラセメントールプロピレングリコール-カーボネートを染み込ませた濾紙をテーブルの脚の中間位置周囲に貼った。試験化合物は、エタノールに溶解し、前もって重量を測定した2インチ×7インチの濾紙片に染み込ませた。エタノールが完全に蒸発した後、濾紙の重量を測定し、試験化合物の濃紙1cm²当たりの最終重量を決定した。エタノールだけに浸した同じ

[0065]

【表2】

表11

試験群	濃度 (mg/cm ²)	バリア検断までの時間 (分) *
コントロール	0	<1
ラセメントールプロピレングリコール- カーボネート	15	63±18
ラセメントールプロピレングリコール- カーボネート	30	760±76

各データ点は、5回の試験の平均±SDである。

【実施例3】

[0066]

一般的なイエバエ、*Musca domestica*を、捕蝶網を使って集め、1立方フィートの網ケージの中に入れた。イエバエは試験前3時間、新しい環境に慣らした。標準的な生の牛肉のスライスをケージの中央に置いて、イエバエを誘引した。ラセメントールプロピレングリコール-カーボネートを、95%エタノールに、10%~50%v/vの濃度範囲で加えた。これら実験溶液を、スプレーボトルを使って牛肉の表面に均一に噴霧した。コントロール試験は、いずれの試験化合物も含まない95%エタノール溶液を用い、これを同様にしてビープの表面に噴霧した。保護時間は、生の牛肉の表面に最初にイエバエがとまった時間である。

[0067]

上記試験中に得たデータを図2に示すが、データは、生の牛肉の表面へイエバエがとまることが用量依存的に阻止されることを示しており、メントールプロピレングリコール-カーボネートが、イエバエがたかることからの処理面の保護に効果的であることを示している。

【実施例4】

[0068]

メントールプロピレングリコール-カーボネートにDEETおよびシトロネラを組合せることの効果

メントールプロピレングリコール-カーボネート（メントールプロピレングリコール-カーボネート）が、蚊が刺す行動に対する既知昆虫忌避剤である、DEETの阻止効果を増強することについての効力を試験するために、ラセメントールプロピレングリコール-カーボネートにDEET (Sigma-Aldrichより購入) を組み合わせて本調査を実施した。2種類の化学物質を親水性軟膏基材 (E.Fougera & CO., Melville, NY) に10%w/wで加えて、ヒトボランティアの露出した腕に塗布した。処置した腕を蚊のチャンバーに差し込み、保護時間を測定した。この調査で得たデータは図3に示されており、データはDEETを含む軟膏基材に10%のラセメントールプロピレングリコール-カーボネートを加えると、2種類のいずれかの方の活性化合物単独の場合に比べて保護時間が長くなることを示している。記録されたデータは、3名のヒトボランティアの平均値および標準誤差である。

[0069]

他の既知の蚊忌避製品の効果増強に関するメントールプロピレングリコール-カーボネートの効力を試験するために、Tender Corporation (Littleton, New Hampshire) 製造のシトロネラバスの製品 (Natranel) にメントールプロピレングリコール-カーボネートを10%w/wの濃度で加える実験を行った。シトロネラオイルは、昆虫忌避活性を持つ植物、*Cymbopogon nardus*の葉から得る、悪臭を持つ天然抽出物である。メントールプロピレングリコール-カーボネートは、Natranelの保護時間を23分から108分に延長し、それにより

野外蚊試験

メントールプロピレングリコールカーボネートの効力を、自然の周囲条件において実証するために、この化学物質を軟膏基材中に10%w/wで混合し、ヒトボランティアの露出した腕に塗布し、このボランティアは午後3:00に開始して、蚊が最も活発に刺す時間、野外にとどまった。保護時間を記録し、SC Johnson & Sons, Inc. (Racine, Wisconsin) 製造の市販昆虫忌避剤 (OFF! Skintastic; 7% DEET) を使用したヒトボランティアより得た記録と比較した。コントロール軟膏は、活性成分を含まないFougera軟膏である。保護時間は、各試験群について、3名のヒトボランティアについて測定した。

[0071]

下表IIIは、10%ラセミメントールプロピレングリコールカーボネートの効力が、OFF! S 10 kintasticより若干高いことを示しており、従って実験室で見られた効力が自然の条件でも再現できることが証明された。

[0072]

[表3]

表III

試験群	保護時間 (分±SEH)
コントロール	10±3
OFF! SKINTASTIC	19±4
10%ラセミメントールプロピレングリコールカーボネート	22±19

[実施例6]

[0073]

シロアリ発生阻止

ミルクシロアリ (milk termite)、Coptotermes vastator (フィリピンイエシロアリ) は、熱帯および亜熱帯地域に見られる害虫である。ラセミメントールプロピレングリコールカーボネートの効力を試験するために、この化学物質を95%エタノールに、10%w/wの濃度で溶解し、前もって重量を測定しておいた軟材をこの溶液に24時間浸した。含浸後、木を空气中で乾燥させて、低い引火点を有するエタノールを除いた。乾燥した木の重量を再度測定して木に吸収されたラセミメントールプロピレングリコールカーボネートの量を決定した。木に吸収されたラセミメントールプロピレングリコールカーボネートの重量は、木1グラム当たり26ミリグラムであった。コントロールは、95%エタノールだけに含浸した木を用いて調製した。

[0074]

本試験サンプルを、周囲の自然な野外条件でシロアリがひどく発生しているジャックツリー (Artocarpus heterophylla) の倒木の表面に2ヶ月置いた。試験期間終了時に、木のサンプルからクズおよびシロアリを取り除き、天日乾燥して重量を測定した。木の保存度は、試験期間中の損失重量によって決定した。

[0075]

[表4]

表IV

処理群	消失重量のパーセント
コントロール	28.6±7.1
ラセミメントールプロピレングリコールカーボネート	0.8±0.4

[0076]

表IVのデータは、シロアリは、コントロール群の木を調査期間中に粉砕できることを示している。定期的に目視でチェックしたところ、コントロール群の木のサンプルの中にはシ

【0077】

ヒアリに対するメントールプロピレングリコールカーボネートの効果
ヒアリは、米国北部にいる厄介な害虫である。トロピカルヒアリ (*Solenopsis geminata* Fabricius) は米国土着種である。しかしながら、より攻撃的な輸入種のアカリ (*S. invicta*) が、その攻撃性故に、米国の南部で優勢になっている。ヒアリは57種の栽培植物に被害を与えることで知られている。これらのアリは発芽中の種子だけでなく他の昆虫も食べる。電流に誘引されることから、これらのアリはまたヒートポンプ、空調設備、電話接続ボックス、変圧器、および交通信号機にも重大な被害を与えている。ヒアリは、ヒトを刺し、局所に強い灼熱痛と癢痕を残すことで有名である。

【0078】

本調査では、ラセミメントールプロピレングリコールカーボネートの忌避効果を、この化学物質の50%濃度(v/v)でエタノール溶液を調製することで調べた。溶液をポンプスプレーディスペンサ (Arminak & Associate, Duarte, CA) を使い、砂糖を使った食品 (この場合はピーナッツバター) から作った餌に噴霧した。コントロールは、エタノールだけにした。この調査は、Fort Pierce, Floridaで行った。保護時間は、最初のアリが餌を食べ始めた時間として測定した。表Vのデータは、ラセミメントールプロピレングリコールカーボネート溶液を噴霧した餌が、少なくとも5時間ヒアリから保護されたことを示している。実験は5時間観察した後に終了した。各調査群とも、4重測定で行われた。エタノールだけ噴霧したコントロールでは、噴霧後3分以内に餌にヒアリ (*s. invicta*) が見られた。

【0079】

【表5】

表5

	保護時間
エタノール溶液噴霧 (コントロール)	3分
50%ラセミメントールプロピレングリコールカーボネート噴霧	>5時間

【実施例8】

【0080】

ハロイサイトクレーに取り込んだメントールプロピレングリコールカーボネートの、蚊に対する忌避効果

本調査は、忌避効果を生ずるのに必要なラセミメントールプロピレングリコールカーボネートの量を減らす手段としての封入または取り込みの好適性を評価し、そして調合物内の他の賦形剤による分解から、または、織物材料に含浸させる場合のように、製造に伴う高温による分解から活性材料を保護する手段を提供するために実施した。ハロイサイトクレーは、工業分野で入手できる多くのその他の適切な封入材料の一例であり、本発明の範囲を制限する意図はない。

【0081】

ハロイサイトクレーは、天然の、無毒の生体分解性材料で、一般的には容器、ポンプチャイナおよびファインチャイナの製造に用いられる。PriceおよびGaberの米国特許第5,651,976号は、ハロイサイトクレーから作られたマイクロチューブルを用いた制御放出の新しい方法を記載している。これらマイクロチューブルは、約0.2マイクロメートルの中空コアを持つ円筒であり、その中に活性化合物を充填すること、そして中空コアからゆっくり活性成分を放出させることができるという特徴を有している。本調査で用いたラセミメントールプロピレングリコールカーボネートを取り込んだハロイサイトは、Federal Technology Group (Bozeman, MT) より提供されたものであり、取り込んだ活性化合物の

ーボネートを混濁クリームに合計濃度20%w/wで加え、このとき調合物中の全活性物質濃度は3.4%であった。ハロイサイトコントロールでは、ラセミメントールプロピレングリコールカーボネートなしのハロイサイトを、保護クリームに20%w/wになるように加えた。参照調合物は、20%ラセミメントールプロピレングリコールカーボネート含有アロエクリームからなり、この場合はアロエクリームをコントロールに用いた。これら調合物を、ヒトボランティアを対象に、標準的な蚊チャンパーを用いて試験し、前腕に調合物を塗布してチャンパー内にいれた。保護時間を、被験者が最初に蚊に刺された時間として測定した。各調査は、3名のヒトボランティアで構成した。

【0082】

表VIに記録されたデータは、ハロイサイトクレール内のラセミメントールプロピレングリコールカーボネートの組み入れは、この活性物質の総必要量を減らしたが、実質的に同じ忌避効果を生じたことを示している。20%ラセミメントールプロピレングリコールカーボネートクリームの保護時間は、3.4%メントールプロピレングリコールカーボネートを取り込んだハロイサイトクレールについて観察された時間と同様であった。

【0083】

【表6】

表VI

保護時間 (平均±SEM)	
コントロール アロエクリーム	17±4
20%ラセミメントールプロピレングリコールカーボネート	
含有アロエクリーム	93±6
コントロール ハロイサイトクリーム	30±3
3.4%メントールプロピレングリコールカーボネート	
を取り込んだハロイサイト	95±9

【実施例9】

【0084】

サシバエに及ぼすラセミメントールプロピレングリコールカーボネートの効果
サシバエまたはドッグフライ (dog fly) (*Stomoxys calcitrans*) はイエバエに近い大きさを持ち、おそらく乳牛およびその他農業動物にとって最も問題のある害虫である。馬の飼育が一般化したことで、今やこれらのハエは馬小屋でも同様に大きな問題になっている。サシバエは皮膚を穿刺して血を吸い、家畜に痛みと不快感をもたらす。サシバエの繁殖は、ウシでは25%もの体重減少をもたらし、牛乳生産量を60%も低下させる。動物がいらない場合には、サシバエはヒトも襲う。

【0085】

ラセミメントールプロピレングリコールカーボネートの効力を試験するために、50%溶液を95%エタノールで調製し、標準的なスプレーボトルを使って噴霧した。サシバエは、試験1日前に、馬小屋の側に、餌 (Peaceful Valley Farm Supply, Grass Valley, CA) が入った網を張ったゲージを置いて採集した。ゲージ毎に約200匹のサシバエを集めた。牛肉片を含む試験餌を、採取ゲージの底に置いたアルミニウムの皿の中に入れた。試験は、50%ラセミメントールプロピレングリコールカーボネート溶液を噴霧した肉を用い、エタノールのみ噴霧した肉をコントロールとして行った。試験は二重測定で実施した。肉にとまり、肉を摂食したサシバエの数を定期的に計測した。

【0086】

下表VIIのデータは、ラセミメントールプロピレングリコールカーボネートが、サシバエによる処理肉の摂食防止に有効であることを示している。1または2匹のハエは、処置肉にとまったが、いつまでも摂食せずに直ぐに移動した。コントロール群では、ハエは直ぐにたかり、数を増した。ラセミメントールプロピレングリコールカーボネートの噴霧

【表 7】

表 VII

サシバエに及ぼすラセメントールプロピレングリコールカーボネートの効果

時間 (分)	蛹に降り立ったハエの数	
	コントロール群	実験群
1	3	0
5	8	0
30	15	0
60	> 30*	0
120	> 30	0
180	> 30	1
240	> 30	1
300	12	0
540	> 30	> 30

10

*蛹はハエによって埋め尽くされ、正確な数は数えられなかった。

【0088】

前述実施例に記載のデータは、上記式Iの化合物が昆虫忌避剤として有効であることを示している。

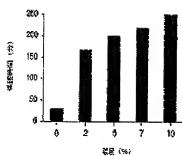
【0089】

前述の明細書の中には、本発明に関連する技術の水準を説明するのを助けるために、多数の特許文書を引用している。これら各引用の全ての開示は、参照により、本明細書に組み入れられる。

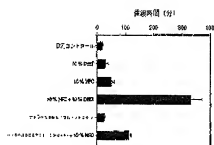
【0090】

本発明のある実施形態を上記記載し、および／または例示してきたが、前述の開示から、様々なその他態様が当業者に明らかになるだろう。それゆえに、本発明は記載した、および／または例示した特定の態様に限定されるものではなく、添付の特許請求の範囲から逸脱することなく、変形および改良を考慮することができる。

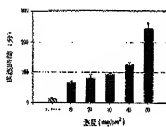
【図1】



【図3】



【図2】



[国際調査報告]

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP04/06800

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC(7) : A61N 37/00 US CL : 514/528; 424/405,406 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) U.S. : 514/528; 424/405,406 Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) WEST		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	US 6,326,982 B1 (SHIMIZU et al) 11 December 2001, the entire document.	1-22
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents: "A" documents defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "B" earlier applications of patent published on or after the international filing date "L" document which may draw claims to priority claims or which is cited to establish the published date of priority claims or other special status (as specified) "O" documents referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" documents published prior to the international filing date but that do not specify dates of citation	"T" later documents published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to undermine the principle or theory underlying the invention "X" documents of particular relevance: the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step since the document is more than "Y" document of particular relevance: the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "A" document: member of the same patent family	
Date of the actual completion of the international search 07 December 2004 (07.12.2004)		Date of mailing of the international search report 19 JAN 2005
Name and mailing address of the ISA/US Math Group PCT, Amer ISA/US Communications for Patents P.O. Box 1490 Alexandria, Virginia 22315-1490 Facsimile No. (703) 305-5230		Authorized officer [Signature] Telephone No. 571-272-0900
Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1996)		

フロントページの続き

(51)Int.Cl.

F I

テーマコード (参考)

A 6 1 K	8/33	(2006.01)	A 6 1 K	8/33	
A 6 1 Q	17/02	(2006.01)	A 6 1 Q	17/02	
B 0 5 D	5/00	(2006.01)	B 0 5 D	5/00	Z
B 0 5 D	7/24	(2006.01)	B 0 5 D	7/24	3 0 2 U

(81)指定国

AP(BW,GH,GM,KE,LS,MW,MZ,NA,SD,SL,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AH,AZ,BY,KG,KZ,MD,RU,TJ,TM),
EP(AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HU,IE,IT,LU,MC,NL,PL,PT,RO,SE,SI,SK,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,
CI,CH,GA,GN,GQ,GM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CN,CO,CR,CU,CZ,
DE,DK,DM,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,HR,HU,ID,IL,IN,IS,JP,KE,KG,KP,KR,KZ,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LV,M
A,MD,MG,MK,MN,MM,MX,MZ,NA,NE,NO,NZ,OM,PG,PH,PL,PT,RO,RU,SC,SD,SE,SG,SK,SL,SY,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG
,US,UZ,VC,VN,YU,ZA,ZM,ZW

Fターム(参考) 4H011 AC06 BA01 BB06 DA17 DA21 DB05 DD05 DD06

43038 CD021 CF001 CF021 DB001 DD231 DF001 DG001 DL031 JA62 JA63

JB01 NA05 PB01 PB02